

KAISERLICHES PATENTAMT.



PATENTSCHRIFT

— № 249241 —

KLASSE 12 o. GRUPPE 16.

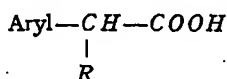
AUSGEGEBEN DEN 13. JULI 1912.

FARBENFABRIKEN VORM. FRIEDR. BAYER & CO. IN ELBERFELD.

Verfahren zur Darstellung von Derivaten α -aryllierter Säuren.

Patentiert im Deutschen Reich vom 1. Mai 1910 ab.

Es wurde gefunden, daß die Amide und Ureide von α -arylierten Säuren der Formel:



(wobei R Alkyl bedeutet, mit Ausnahme von Methyl und Isopropyl, für den Fall, daß Aryl = Phenyl ist) sehr wertvolle therapeutische Eigenschaften besitzen. Die neuen Körper sind fast geschmacklos. Da sie außerdem vom Magen gut vertragen werden und den Appetit nicht beeinflussen, haben sie sich als wertvolle Sedativa erwiesen. Sie haben außerdem wertvolle hypnotische und antipyretische Eigenschaften und besitzen diese therapeutisch wertvollen Eigenschaften gegenüber den bekannten Amiden dieser Reihe, z. B. dem Hydratropasäureamid in erhöhtem Maße. Zu ihrer Darstellung verfährt man in der Weise, daß man die α -arylierten Säuren obiger Formel oder ihre Derivate, wie Nitrile, Ester, Chloride, in üblicher Weise in Amide oder Harnstoffverbindungen überführt.

Beispiel 1.

178 Teile α -Phenyl-n-valeriansäure (Ber. 22, 1235, Compt. rend. 150, 533) (der in der Literatur noch nicht angegebene Siedepunkt dieser Säure liegt bei 280°) werden portionsweise in eine Emulsion von 208 Teilen fein gepulvertem Phosphorpentachlorid in Chloroform eingetragen. Nach beendeter Salzsäureentwicklung destilliert man das Chloroform und Phosphoroxychlorid im Vakuum ab, fügt den Rückstand zu einem Überschuß von kaltem wässrigem Ammoniak unter Rühren und isoliert das gebildete α -Phenyl-n-valeriansäureamid

durch Absaugen. Aus mäßig verdünntem Alkohol umkristallisiert, zeigt es den Schmelzpunkt 83 bis 85°. In organischen Lösungsmitteln ist es leicht, in Wasser schwer löslich.

Zum gleichen Amid gelangt man durch partielle Hydrolyse des α -Phenyl-n-valeronitrils (Ber. 22, 1235, Compt. rend. 150, 533).

Durch Erwärmen des oben erwähnten α -Phenyl-n-valerylchlorids mit Harnstoff im Wasserbad erhält man das entsprechende Ureid, mit Glycocol das entsprechende Glycin, mit Äthylamin das Äthylamid.

Beispiel 2.

α -Phenyl-n-buttersäure (Phenyläthyllessigsäure) wird in bekannter Weise durch Behandeln mit Phosphortri- oder -pentachlorid in des entsprechende Chlorid übergeführt. 182,5 Teile des so erhaltenen Chlorids werden mit 120 Teilen Harnstoff im Wasserbad bis zur Beendigung der Salzsäureentwicklung verschmolzen. Beim Anarbeiten der Reaktionsmasse in der üblichen Weise erhält man den Phenyläthylacethylharnstoff vom Schmelzpunkt 147°.

Das diesem Harnstoff entsprechende α -Phenyl-n-buttersäureamid zeigt den Schmelzpunkt 86°.

Beispiel 3.

Benzylcyanid wird durch Behandeln mit Natriumamid in ätherischer Lösung in das Natriumsalz und dieses durch Einwirkung von Diäthylcarbinolbromid in das Phenylisoamylacetonitril übergeführt.

100 Teile des so erhaltenen Nitrils werden mit 100 Teilen Ätzkali, 50 Teilen Wasser und

75 Teilen Alkohol 8 Stunden unter Rühren auf 100° erhitzt. Beim Aufarbeiten nach bekannten Methoden erhält man das Phenylisoamylacetamid vom Schmelzpunkt 138°.

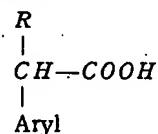
5 Statt der in den obigen Beispielen angewandten Säuren können auch andere der genannten Säuren oder ihre Derivate Verwendung finden, z. B. die α -p-Tolyl-n-buttersäure, die α -o- oder p-Tolylpropionsäure usw.

10 PATENT-ANSPRUCH:

Verfahren zur Darstellung von Derivaten α -arylierter Säuren, dadurch gekennzeichnet,

net, daß man α -arylierte Säuren der allgemeinen Formel:

15



20

oder ihre Derivate (wobei R Alkyl bedeutet, mit Ausnahme von Methyl- und Isopropyl für den Fall, daß Aryl = Phenyl ist) in üblicher Weise in ihre Amide oder Ureide 25 überführt.